

研究所員の受賞

学 会 名：平成13年度日本生薬学会学術奨励賞（2001年 9 月 8 日）

受賞題目名：「東南アジア産薬用植物の生物活性成分に関する研究」

化学応用部門 手 塚 康 弘

研究内容：

東南アジアは日本とは大きく異なる植物相を有し、種々の生物活性物質の宝庫とも言える。植物の多くは、各国独自の多種多様な伝統・伝承医療の形で薬用に供されてきたが、それらに関する科学研究は植物相の豊富さに比べるとほとんど行われていないに等しい。一方、近年の種々の開発やそれに伴う環境破壊、地球温暖化等の進展に伴って、これら重要かつ特異な天然資源が失われつつあり、多種多様な天然資源を評価して有益なものを選択し、より有効な資源へと改良していく事が必要とされている。以下に、インドネシア、ベトナム、ミャンマーの薬用植物に関する最近の研究成果について略記する。

【インドネシア産薬用植物】インドネシアで *Seperantu* の名で熱病、梅毒、淋病等に用いられている *Sindora sumatrana* Miq. (Leguminosae) の莢の MeOH エキス CHCl_3 可溶部から新セスキテルペン 8 種及び *trans-clerodane-type* 新ジテルペン 7 種を既知セスキテルペン 9 種、*trans-clerodane-type* 既知ジテルペン 3 種と共に単離し、構造を決定した。さらに、*Helicteres isora* L. (Sterculiaceae) のトリ急性白血病ウィルスの逆転写酵素に対する阻害活性成分の検討を行い、(7.5',8.2')-neolignan 2 種、(6.4',7.5',8.2')-neolignan 1 種、(7.5',8.2')-neolignan 二量体 6 種新化合物として得た。新ネオリグナン中、二量体の *hericterins* A-F が逆転写酵素阻害活性を示し、*helicterin* A の活性は *adriamycin* と同程度であった。

【ベトナム産薬用植物】ベトナムで “*Tram bau*” の名で解熱薬、抗赤痢薬、駆虫薬、抗肝炎薬として用いられている *Combretum quadrangulare* KURZ (Combretaceae) の葉の MeOH エキスから、新 *cycloartane-type* トリテルペン 28 種を既知化合物 12 種と共に単離・構造決定した。その中で、新 *cycloartane-type* トリテルペンの *methyl quadrangularates* A, I, *quadrangularol* B, 既知フラボンの *kamatakenin*, 5,7,4'-trihydroxy-3,3'-dimethoxyflavone, 5,4'-dihydroxy-3,7,3'-trimethoxyflavone, *isokaempferide*, *vitexin* が肝細胞保護活性を示した。また、*methyl quadrangularates* B, D, *kamatakenin*, 5,7,4'-trihydroxy-3,3'-dimethoxyflavone, 5,4'-dihydroxy-3,7,3'-trimethoxyflavone, *isokaempferide* は細胞増殖阻害活性を示した。さらに、実の MeOH エキス水可溶部から、新トリテルペングルコシド 11 種と新グルコースガレイト 1 種を既知化合物 24 種と共に得、*lupane-type* トリテルペングルコシド、共役二重結合を有する *ursane-type* トリテルペングルコシド、新グルコースガレイト、*epicatechin* が強い肝細胞保護活性を有する事を示した。また、ベトナム人参 *Panax vietnamensis* (Araliaceae) の MeOH エキスに D-GalN/TNF- α 誘発マウス肝細胞死に対する保護作用を見出し、新サポニン 2 種及び既知サポニン 9 種を単離・構造決定した。得られたサポニン中、ベトナム人参に特徴的な *majonoside* R₂ 等 *ocotilon-type* の化合物が肝保護活性を示した。

【ベトナム及びミャンマー産 *Orthosiphon stamineus* の新規ジテルペン】ベトナム産 *Orthosiphon stamineus* BENTH. の MeOH エキスから、新ジテルペン 10 種を既知化合物 16 種と共に得、ミャンマー産本植物から、*isopimarane-type* 新ジテルペン 8 種、*norstaminane-type* 新ジテルペン 1 種、既知 *isopimarane-type* ジテルペン 7 種、既知 *staminane-type* ジテルペン 1 種を得た。

【ミャンマー産薬用植物 *Acacia concinna* WALL. の細胞毒性成分】ミャンマーでシャンプー、育毛剤、皮膚病等に用いられている *Acacia concinna* (Leguminosae) の莢は、従来から多数のサポニンを含む事が知られていた。しかし、その複雑さのためサポニンの単離に成功した例は無かったが、今回、初めて新サポニン 3 種を単離・構造決定し、5-fluorouracil と同程度の活性を示す事を示した。

上記の化合物は、興味深い活性と構造を有し医薬品化学上新知見を供したものの、新規な骨格を有し生合成上新たな知見を供したものの、同種植物であるにもかかわらず従来知られていたものと異なる成分組成を示し民族薬学的に興味深いもの等、天然物化学のみに止まらず多方面へ有益な知見を提供し得た。